



(WO/1995/031956) ANTIBACTERIAL OIL-IN-WATER EMULSIONS

Biblio. Data	Description	Claims	National Phase	Notices	Documents
--------------	-------------	--------	----------------	---------	-----------

Latest published bibliographic data

Publication No.: WO/1995/031956 International Application No. PCT/US1995/006234
 Publication Date: 30.11.1995 International Filing Date: 18.05.1995

Int. Class.⁸: A61K 3/127, A61K 31/14, A61K 31/23, A61K 31/231, A61K 45/06.

Applicant: NOVAVAX, INC.

Inventor: WRIGHT, D., Craig.

Priority Data: 08/246,868 20.05.1994 US

Title: (EN) ANTIBACTERIAL OIL-IN-WATER EMULSIONS
 (FR) EMULSIONS HUILE-DANS-EAU ANTIBACTERIENNES

Abstract: (EN) An antibacterial oil-in-water emulsion for inhibiting the growth of *Helicobacter pylori* is disclosed. The oil-in-water emulsion of the invention comprises droplets of an oily discontinuous phase dispersed in a continuous phase. The oily discontinuous phase contains an oil carrier and a glycerol ester selected from the group consisting of glycerol monooleate and glycerol monostearate. The emulsion can be positively charged, negatively charged or chargeless. In one embodiment, the emulsion is positively charged and further comprises a cationic halogen-containing compound having a C12-C16 chain as a positive charge producing agent. In another embodiment, the emulsion is negatively charged and further comprises a negative charge producing agent having a C12-C22 chain. The disclosed emulsions can be administered to individuals, for example, orally, to treat or prevent *Helicobacter pylori* infections.

(FR) L'invention décrit une émulsion huile-dans-eau antibactérienne destinée à inhiber la croissance d'*Helicobacter pylori*. L'émulsion huile-dans-eau selon l'invention comprend des gouttelettes d'une phase huileuse discontinue dispersée dans une phase continue. La phase huileuse discontinue contient un véhicule huileux et un ester de glycérol sélectionné dans le groupe composé de mono-oléate de glycérol et de monostéarate de glycérol. L'émulsion peut porter une charge positive, une charge négative ou aucune charge. Dans une forme de réalisation, l'émulsion porte une charge positive et comporte en outre un composé halogéné cationique avec une chaîne C12-C16 jouant le rôle d'agent producteur de la charge positive. Dans une autre forme de réalisation, l'émulsion porte une charge négative et comporte en outre un agent producteur de la charge négative qui contient une chaîne C12-C22. Les émulsions décrites peuvent être administrées à des sujets, par exemple par voie orale, pour le traitement ou la prévention des infections à *Helicobacter pylori*.

Designated States: AM, AT, AU, BB, BG, BR, BY, CA, CH, CN, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, GB, GE, HU, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LK, LR, LT, LU, LV, MD, MG, MN, MW, MX, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, TJ, TM, TT, UA, UZ, VN, KE, MW, SD, SZ, UG, AT, BE, CH, DE, DK, ES, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, ML, MR, NE, SN, TD, TG.

[19]中华人民共和国专利局

[51]Int.Cl⁶

A61K 6/00



[12] 发明专利申请公开说明书

[21] 申请号 95194252.2

[43]公开日 1997年9月10日

[11] 公开号 CN 1159158A

[22]申请日 95.5.18

[30]优先权

[32]94.5.20 [33]US[31]08 / 246,868

[32]94.10.13[33]US[31]08 / 322,827

[32]94.10.26[33]US[31]08 / 329,730

[86]国际申请 PCT / US95 / 06234 95.5.18

[87]国际公布 WO95 / 31956 英 95.11.30

[85]进入国家阶段日期 97.1.20

[71]申请人 诺瓦瓦克斯有限公司

地址 美国马里兰州

[72]发明人 D·C·莱特

[74]专利代理机构 中国专利代理(香港)有限公司

代理人 吴玉和 谭明胜

权利要求书 3 页 说明书 12 页 附图页数 0 页

[54]发明名称 抗菌水包油乳液

[57]摘要

本发明公开了一种用于抑制幽门螺旋杆菌生长的抗菌水包油乳液。本发明的水包油乳液包含分散在连续相中的油不连续相微滴。油不连续相含有油载体和选自甘油一油酸酯和甘油一硬脂酸酯的甘油酯。该乳液可以带正电荷、带负电荷或不带电荷。在一个实施方案中,乳液带正电荷,并另外含有作为正电荷生成剂的具有 C₁₂-C₁₆ 链的阳离子含卤素化合物。在另一个实施方案中,乳液带负电荷,并另外含有具有 C₁₂-C₂₂ 链的负电荷生成剂。此乳液可用于如通过口服对人给药,来治疗或预防幽门螺旋杆菌感染。

权 利 要 求 书

1. 一种能灭活幽门螺旋杆菌的水包油抗菌乳液, 其含有分散在连续水相中的油不连续相微滴, 该乳液包含:

- a. 一种油; 和
- 5 b. 一种甘油酯, 它选自: 甘油一油酸酯, 甘油一硬脂酸酯, 甘油三油酸酯, 甘油一月桂酸酯和甘油二月桂酸酯。

2. 权利要求 1 的抗菌乳液, 其中甘油酯是甘油一油酸酯或甘油一硬脂酸酯。

10 3. 权利要求 1 的抗菌乳液, 其中油不连续相还含有具有 C_{12} - C_{16} 链的阳离子含卤素化合物。

4. 权利要求 1 的抗菌乳液, 其中油不连续相还含有具有 C_{12} - C_{22} 链的负电荷生成剂。

15 5. 权利要求 1 的抗菌乳液, 其中油不连续相另外还含有至少一种选自如下种类的固醇: 胆固醇, 胆固醇衍生物, 氢化可的松, 植物固醇, 以及它们的混合物。

6. 权利要求 1 的抗菌乳液, 其中油选自: 大豆油, 角鲨烯油, 芝麻油, 橄榄油, 卡诺拉油, 玉米油, 菜籽油, 红花油, 葵花油, 鱼油, 鳄梨油, 香料油, 水不溶性维生素, 以及它们的混合物。

7. 权利要求 6 的抗菌乳液, 其中所说的香料油包括薄荷油。

20 8. 权利要求 3 的抗菌乳液, 其中卤素选自溴、氯和氟。

9. 权利要求 8 的抗菌乳液, 其中具有 C_{12} - C_{16} 链的阳离子含卤素化合物选自: 十六烷基吡啶鎓氯化物, 十六烷基吡啶鎓溴化物, 十六烷基三甲基铵溴化物和十六烷基二甲基乙基铵溴化物。

25 10. 权利要求 1 的抗菌乳液, 其中乳液的至少一部分是以选自如下种类的带正电荷的脂质结构形式存在: 单层, 多层和少层的脂囊泡, 微胞和片层状结构。

11. 一种适合于医用给药的抗菌制剂, 其包含权利要求 1 的抗菌乳液和药用载体。

30 12. 一种用于灭活革兰氏阴性菌的抗菌水包油乳液, 其含有分散在连续水相中的油不连续相微滴, 该乳液包含:

- a. 一种选自如下种类的油: 大豆油, 角鲨烯油, 芝麻油, 橄榄油,